



VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055414/NI	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEAA16	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/002426	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 08.03.2005	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 10.03.2004
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07D487/04 A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 2 Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Berichts</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 29.06.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 02.06.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - Gitschiner Str. 103 D-10958 Berlin Tel. +49 30 25901 - 0 Fax: +49 30 25901 - 840	Bevollmächtigter Bediensteter Hass, C Tel. +49 30 25901-340 	

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bescheid auf

- ☒ der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde.
- ☐ einer Übersetzung der internationalen Anmeldung in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 a) und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4 a))
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 a) und/oder 55.3 a))

2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt):*

Beschreibung, Seiten

1-18 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10 eingegangen am 16.05.2006 mit Telefax

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☐ Ansprüche: Nr.
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☐ Ansprüche: Nr.
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/002426

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche 1-10
	Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja: Ansprüche 1-10
	Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja: Ansprüche: 1-10
	Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

V.1 Zitierte Dokumente

- D1: EP-A-0 141 317 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 15. Mai 1985 (1985-05-15)
- D2: WO 03/009687 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 6. Februar 2003 (2003-02-06)
- D3: EP-A-0 215 382 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 25. März 1987 (1987-03-25)
- D4: GB-A-1 148 629 (VEB. DEUTSCHES HYDRIERWERK RODLEBEN) 16. April 1969 (1969-04-16)
- D5: EP-A-0 770 615 (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 2. Mai 1997 (1997-05-02)

Die angegebenen Bezeichnungen gelten für das gesamte Prüfungsverfahren.

V.2 Neuheit

V.2.1 Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 ist vom Gegenstand der Ansprüche 1-6 des Dokuments D1 generisch umfasst. Es gibt aber in D1 keine konkreten Einzelverbindungen, die unter die vorliegenden Ansprüche fallen: Bei denjenigen konkreten D1-Verbindungen, bei denen R^2 n-Propyl oder n-Butyl ist, fällt der Rest R^1 gerade außerhalb des in der Anmeldung beanspruchten Bereiches, und bei denjenigen konkreten D1-Verbindungen, bei denen R^1 in den hier beanspruchten Bereich fällt, ist R^2 nicht n-Propyl oder n-Butyl (siehe D1, Tabelle auf den Seiten 9 und 10). Daher beruht der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche auf einer neuen Auswahl aus D1.

V.2.2 Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche unterscheidet sich von der Offenbarung in D2 durch die Definition der Gruppe R^2 , die der Gruppe X in D2 entspricht.

V.2.3 Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche unterscheidet sich von den in D3 offenbarten Verbindungen zumindest darin, dass dort der der Gruppe R^1 entsprechende Rest immer eine Arylgruppe trägt.

V.2.4 In den in D4 offenbarten Verbindungen hat die R¹ entsprechende Alkylgruppe nur maximal 4 C-Atome.

V.2.5 D5 offenbart ein Verfahren zur Herstellung der Zwischenprodukte der Formeln IV und V. Bei den konkret in D5 genannten Verbindungen ist jedoch der der Gruppe R¹ entsprechende Rest Phenyl.

V.2.6 Somit ist der Gegenstand aller vorliegenden Ansprüche neu.

V.3 Erfinderische Tätigkeit

V.3.1 Gemäß der Beschreibung ist die der Anmeldung zugrunde liegende Aufgabe darin zu sehen, 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine bereitzustellen, die den aus D1 bekannten ähnlichen Verbindungen in ihrer fungiziden Wirkung überlegen sind.

V.3.2 Relevanter Stand der Technik für den Gegenstand des Anspruchs 1 sind die Dokumente D1 bis D3, da sie fungizid wirksame 7-Amino-triazolopyrimidine offenbaren. Der strukturell nächste Stand der Technik ist D1, da es Verbindungen offenbart, von denen sich die anmeldungsgemäßen Verbindungen entweder nur hinsichtlich der Gruppe R¹ unterscheiden (Verbindungen 16, 21, 23, 42 und 48 aus D1) oder von denen sie sich nur hinsichtlich der Gruppe R² unterscheiden (z. B. Verbindungen 4, 10, 11, 12, 29 aus D1). Generisch sind die anmeldungsgemäßen Verbindungen vollständig von der Offenbarung von D1 umfasst (siehe D1, Ansprüche).

V.3.3 Der Fachmann, der vor der oben definierten Aufgabe steht, würde sicherlich die allgemeine Offenbarung aus D1 zum Anlass nehmen, neue, aber innerhalb der generischen Offenbarung von D1 liegende Verbindungen herzustellen, wobei er davon ausgehen könnte, dass diese Verbindungen ebenfalls fungizide Eigenschaften hätten. Genau das ist im vorliegenden Fall getan worden: Die Anmelderin hat Gruppen R¹ konkret in D1 genannter Verbindungen und Gruppen R² anderer konkret in D1 genannter Verbindungen kombiniert und ist damit direkt zu den anmeldungsgemäßen Verbindungen gelangt. Somit ist es grundsätzlich nicht überraschend, dass die anmeldungsgemäßen Verbindungen ebenfalls, wie die D1-Verbindungen, fungizid wirken.

V.3.4 Die Anmelderin hat nun Vergleichsversuche zwischen bestimmten anmeldungsgemäßen Verbindungen und konkret in D1 genannten Verbindungen vorgelegt, aus denen hervorgeht, dass dann, wenn R^2 n-Propyl oder n-Butyl ist und gleichzeitig R^1 der speziellen in Anspruch 1 gegebenen Definition entspricht (eine Kombination, wie sie in D1 nicht verifiziert wurde), gegenüber konkret in D1 genannten, strukturähnlichen Verbindungen eine wesentliche Verbesserung der Wirkung gegenüber bestimmten Schadpilzen auftritt. Zum Vergleich wurden Verbindungen aus D1 verwendet, deren R^2 entsprechender Substituent ebenfalls n-Propyl bzw. n-Butyl ist, so dass der strukturelle Unterschied lediglich durch R^1 bestimmt wird. Hierbei ergab sich eine nicht vorhersehbare signifikante Verbesserung der Wirkung bei den getesteten anmeldungsgemäßen Verbindungen mit den Resten $R^1 = C_5$ -Alkyl oder C_9 -Alkyl oder C_6 -Alkoxyethylen oder C_8 -Alkoxyethylen.

V.3.5 Die Vergleichsversuche zeigen, dass mit dem Gegenstand der Ansprüche die oben definierte technische Aufgabe tatsächlich gelöst wurde. Die Wirkungsverbesserung aufgrund des spezifischen Substituenten R^1 , die mit den Vergleichsversuchen glaubhaft gemacht wurde, wird im relevanten Stand der Technik nicht nahegelegt und ist daher überraschend.

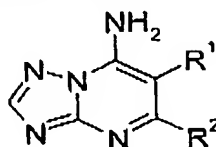
V.3.6 Erfinderische Tätigkeit kann daher für den Gegenstand der nun vorliegenden Ansprüche 1 bis 10 anerkannt werden.

V.4 Gewerbliche Anwendbarkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 ist gewerblich anwendbar.

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R¹ C₅-C₉-Alkyl oder C₃-C₁₀-Alkoxyethylen;

R² n-Propyl oder n-Butyl.

10

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin R¹ für eine unsubstituierte unverzweigte oder ein-, zwei- oder dreifach verzweigte Alkylkette mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen steht.

15

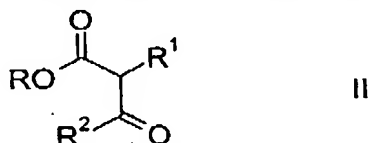
3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, worin R² für n-Propyl steht.

4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, worin R² für n-Butyl steht.

20

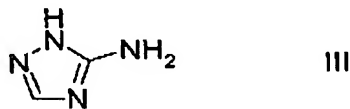
5. 6-(1-Methyl-heptyl)-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
6-Octyl-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
5-Butyl-6-(1-methyl-heptyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
5-Butyl-6-octyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
5-Propyl-6-(3,5,5-trimethyl-hexyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
25 6-Hexyl-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
6-Heptyl-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin.

6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass man β-Ketoester der Formel II,

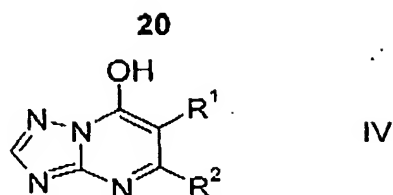


30

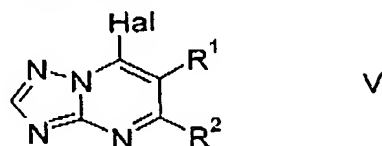
in der R für C₁-C₄-Alkyl steht, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III



zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV



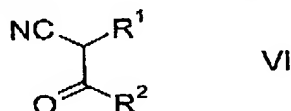
umsetzt, welche zu Verbindungen der Formel V,



in der Hal für Chlor oder Brom steht, halogeniert werden, und V mit Ammoniak umgesetzt wird.

5

7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass man Acylcyanide der Formel VI,



10

mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III gemäß Anspruch 6 umgesetzt.

8. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5.

15

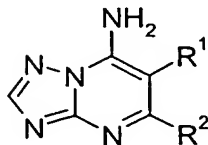
9. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 in Mengen von 1 bis 1000 g pro 100 kg.

20

10. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 behandelt.

We claim:

1. A triazolopyrimidine of the formula I



I

5 in which the substituents are as defined below:

R¹ is C₅-C₉-alkyl or C₃-C₁₀-alkoxyethylene;

R² is n-propyl or n-butyl.

10

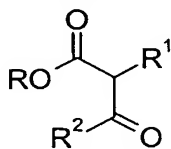
2. The compound of the formula I according to claim 1 in which R¹ is an unsubstituted straight-chain or mono-, di- or tribranched alkyl chain having up to 9 carbon atoms.

- 15 3. The compound of the formula I according to claim 1 or 2 in which R² is n-propyl.

4. The compound of the formula I according to claim 1 or 2 in which R² is n-butyl.

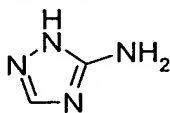
5. 6-(1-Methylheptyl)-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
 20 6-octyl-5-propyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
 5-butyl-6-(1-methylheptyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
 5-butyl-6-octyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
 5-propyl-6-(3,5,5-trimethylhexyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
 6-hexyl-5-propyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
 25 6-heptyl-5-propyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine.

6. A process for preparing compounds of the formula I according to any of claims 1 to 5, wherein β-ketoesters of the formula II,



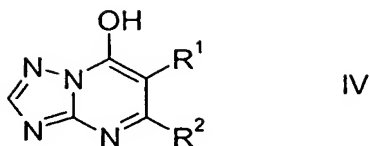
II .

30 in which R is C₁-C₄-alkyl are reacted with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III

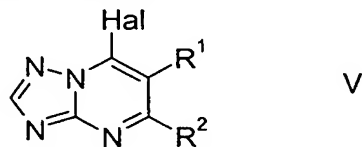


III

to give 7-hydroxytriazolopyrimidines of the formula IV



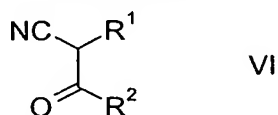
which are halogenated to give compounds of the formula V



in which Hal is chlorine or bromine and V is reacted with ammonia.

5

7. A process for preparing compounds of the formula I according to any of claims 1 to 5, wherein acylcyanides of the formula VI,



are reacted with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III according to claim 6.

10

8. A fungicidal composition comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to any of claims 1 to 5.
9. Seed comprising a compound of the formula I according to any of claims 1 to 5 in amounts of 1 to 1000 g per 100 kg.
10. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi wherein the fungi or the materials, plants, the soil or seed to be protected against fungal attack are treated with an effective amount of a compound of the formula I according to any of claims 1 to 5.

20